

GEL COMPOSITION FOR EXTERNAL USE

Patent number: JP61068413
Publication date: 1986-04-08
Inventor: KOJIMA NOBUO; others: 03
Applicant: LION CORP
Classification:
- International: A61K9/06; A61K7/00
- european:
Application number: JP19840189432 19840910
Priority number(s):

Abstract of JP61068413

PURPOSE:A gel composition for external use that is obtained by using as a gelling agent, a combination of carboxyvinyl polymer with a hydroxyethylcellulose of a specific viscosity in specific amounts to inhibit the gel from being twisted and having improved feeling on use.

CONSTITUTION:The objective composition is composed of a) less than 80wt%, preferably less than 70wt%, based on the total composition, water, b) 0.2-1.5wt% of carboxyvinyl polymer, c) 0.05-0.5%, preferably 0.1-0.5wt% of hydroxyethylcellulose having more than 100cps as 1% of benzyl alcohol, to prevent the composition from being twisted, when applied, further e) 0.05-0.5wt%, preferably 0.05-0.3wt% of polyacrylic acid or its salt to improve handleability.

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

⑫ 公開特許公報(A)

昭61-68413

⑤ Int. Cl.

A 61 K 9/06
7/00

識別記号

庁内整理番号

6742-4C
7306-4C

⑬ 公開 昭和61年(1986)4月8日

審査請求 未請求 発明の数 1 (全5頁)

⑭ 発明の名称 外用ゲル組成物

⑰ 特 願 昭59-189432

⑱ 出 願 昭59(1984)9月10日

⑲ 発 明 者 小 島 信 雄 東京都杉並区阿佐谷南1-37-3
⑲ 発 明 者 吉 川 勝 東京都杉並区上井草1-26-12
⑲ 発 明 者 富 永 安 里 船橋市上山町3-597-43
⑲ 発 明 者 七 浦 亨 鎌ヶ谷市西道野辺1-5-204
⑲ 出 願 人 ライオン株式会社 東京都墨田区本所1丁目3番7号
⑲ 代 理 人 弁理士 小島 隆司

明 細 書

1. 発明の名称

外用ゲル組成物

2. 特許請求の範囲

1. 水が80重量%以下の外用ゲル組成物において、ゲル化剤としてカルボキシビニルポリマーを組成物全体の0.2~1.5重量%及び1%水溶液の粘度が100 cps以上であるヒドロキシエチルセルロースを組成物全体の0.05~0.5重量%配合してなることを特徴とする外用ゲル組成物。

2. ベンジルアルコールを組成物全体の0.5~5重量%配合した特許請求の範囲第1項記載の組成物。

3. ポリアクリル酸又はその塩を組成物全体の0.05~0.5重量%配合した特許請求の範囲第1項又は第2項記載の組成物。

3. 発明の詳細な説明

産業上の利用分野

本発明は、カルボキシビニルポリマー及び水を

含有する外用ゲル組成物に関し、更に詳述すると、塗布時、塗擦時に組成物中の高分子物質がかす化して析出する「よれ」の発生が良好に抑制された外用ゲル組成物に関する。

従来の技術及びその問題点

従来より、ゲル軟膏等の局所用剤や化粧品などの外用ゲル組成物のゲル化剤としてカルボキシビニルポリマーを用いることが知られている。このようなゲル化剤としてカルボキシビニルポリマーを用いた外用ゲル組成物は、通常透明でゼリー状の外観を有し、有効成分等が基剤中に溶解した状態の外用塗布剤であり、一般に有効成分の皮膚浸透性が大きく、しかも塗布面のべとつきが少ないといった利点を有する。

この場合、カルボキシビニルポリマーのゲルを得るには、例えばカルボキシビニルポリマーを溶剤に分散又は溶解した後、適当な中和剤を加え、増粘ゲル化させることによつて行なわれるが、このときの溶剤としては水を主体としたものが最もポピュラーに多用されている。しかし、ゲルに水

不溶性もしくは難溶性の有効成分や香料等を配合する場合は、その可溶化、安定化のために水と共に有機溶剤を使用する必要がある、ここで水の配合量がゲル組成物の80%（重量%、以下同じ）以下になると、ゲル組成物を皮膚に塗布、塗擦した場合に組成物中の高分子物質が皮膚表面で析出しかず化するいわゆる「よれ」が生じ、使用感が低下するという問題がある。この「よれ」はゲル中の有機溶剤の量が多く水の量が少ないほど顕著に現われるものであり、このために従来、溶剤中にヒドロキシプロピルセルロースを添加することによつて「よれ」を防止することが提案されている（特開昭55-40604）が、この方法は「よれ」の防止に充分有効でない上、ヒドロキシプロピルセルロースを多量に配合する必要がある、このため組成物の乾燥過程で糊様の粘着性が発現するという不都合がある。

発明の特徴

本発明者らは、上記事情に鑑み、水を80%以下の割合で含み、カルボキシビニルポリマーでゲル

クリル酸又はその塩を配合することにより、汗などの微量の塩分によつて粘度が低下しすぎ、手にとろうとしても表面が液状化するため手にとれないというカルボキシビニルポリマーをゲル化剤とする従来の外用ゲル組成物の問題点を確実に解決し得ることを知見し、本発明をなすに至つたものである。

以下、本発明につき更に詳しく説明する。

発明の構成

本発明に係る外用ゲル組成物は、水を組成物全体の80%以下、特に70%以下、ゲル化剤としてカルボキシビニルポリマーを組成物全体の0.2~1.5%、特に0.5~1.5%配合した外用ゲル組成物において、1%水溶液の粘度が100 cps以上であるヒドロキシエチルセルロースを組成物全体の0.05~0.5%配合したものであり、フェイスクリーム、外傷剤、外用消炎鎮痛剤、皮膚疾患治療剤、かゆみ止め剤など、皮膚等に塗布する用途に使用するものである。

本発明においては、このように特定のヒドロキ

化した外用ゲル組成物における「よれ」の発生を防止し、その使用感を向上させることにつき鋭意研究を行なっているうち、水が80%以下の外用ゲル組成物中に1%水溶液の粘度が100 cps以上であるヒドロキシエチルセルロースを配合することにより、上記目的が効果的に達成され、「よれ」の発生が効果的に抑制された外用ゲル組成物が得られることを知見した。

即ち、本発明者らは、カルボキシビニルポリマーをゲル化剤として水が80%以下の外用ゲル組成物を製造する場合、そのままでは組成物の使用時に「よれ」が生じる問題があり、この場合に1%水溶液の粘度が100 cpsより小さいヒドロキシエチルセルロースを配合しても、「よれ」が生じるものであつたが、1%水溶液の粘度が100 cps以上であるヒドロキシエチルセルロースを配合した場合は「よれ」の発生が抑制され、使用感が向上するという特異的な効果が生じることを知見した。更にこの場合、ベンジルアルコールを併用すると「よれ」が確実になくなり、またポリア

シエチルセルロースを配合したことにより、水が80%以下、特に70%以下の系をカルボキシビニルポリマーでゲル化した場合に生じる使用時の「よれ」を良好に防止したものである。

ここで、本発明において、カルボキシビニルポリマーとしては、分子内にカルボキシル基を有する分子量約1000000~3000000の範囲のものがいずれも使用し得、具体的にはB.F. Goodrich社製のカルボポール934, 940, 941、和光純薬社製のハイビスワコー103, 104, 105、日本純薬社製のジユンロンPW110, 111等が用いられ得る。なお、本発明においてはこれらカルボキシビニルポリマーの1種を単独で使用しても2種以上を併用するようにしてもよい。

この場合、カルボキシビニルポリマーは必要により塩基性物質で中和することができ、これによつてゲルの性状を適宜調整することができる。ここで、カルボキシビニルポリマーの中和に使用し得る塩基性物質としては、メチルアミン、エチルアミン、プロピルアミン等のアルキルアミン、ジ

メチルアミン、ジエチルアミン、ジプロピルアミン等のジアルキルアミン、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリプロピルアミン等のトリアルキルアミン、メタノールアミン、エタノールアミン、プロパノールアミン等のアルカノールアミン、ジメタノールアミン、ジエタノールアミン、ジプロパノールアミン、ジブタノールアミン等のジアルカノールアミン、トリメタノールアミン、トリエタノールアミン、トリプロパノールアミン、トリブタノールアミン等のトリアルカノールアミン、トリメチロールアミノメタン、ジフエンヒドラミン、ジブカイン塩基、イブシロンアミノカプロン酸などの有機アミン系塩基、更にアンモニア、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの無機塩基等を使用し得るが、含水量が少ない場合には溶解度の点から有機アミン系塩基が好適に使用し得、なかでも調製の容易さの点からアルカノールアミン系が特に好ましい。なお、上記塩基性物質の配合量はカルボキシビニルポリマーの当量中和量とすることが好ましい。

その種類に制限はないが、エチルアルコール等の低級アルコール、プロピレングリコール、1,3-ブチレングリコール等の低級ジオール、グリセリン等の低級トリオール、ポリエチレングリコール等を用いることができる。なお、エチルアルコールについては各種変性アルコールを使用することができる。

本発明組成物には、上記成分に加え、ベンジルアルコールを配合することが好ましく、これによつてヒドロキシエチルセルロースとベンジルアルコールが相乗的に作用し、組成物の「よれ」がいつそう確実に防止される。この場合、ベンジルアルコールの配合量は組成物全体の0.5～5%、特に1～5%とすることが好ましい。

更に、本発明組成物には、ポリアクリル酸又はその塩を配合することが好ましく、これにより組成物の「手のとりにくさ」が改善される。即ち、有機溶剤を含む溶剤をカルボキシビニルポリマーでゲル化した組成物は、汗等に含まれる微量の塩分によつてゲルが崩壊し、液状化して粘度が著し

く低下するため、組成物を手にとろうとしてもそれが手、指から流れ落ちて手にとりにくいという問題があり、これに対してあらかじめ組成物中に微量の塩化ナトリウムを添加しておくことが提案されている(特開昭55-40604)が、この方法は上記問題点の改良に充分有効でない上、製品の粘度が著しく低く抑えられるため、組成物が軟膏としては使用難くなるという欠点があるのに対し、上述したようにポリアクリル酸又はその塩を配合することにより、組成物の粘度が微量の塩分によつて著しく低下することが防止され、組成物が手にとり易くなるものである。ここで、ポリアクリル酸又はその塩としては架橋型でなく直鎖状のものが好ましく、またポリアクリル酸又はその塩の配合量は組成物全体の0.05～0.5%、特に0.05～0.3%とすることが好ましい。なお、ポリアクリル酸又はその塩としてはジユリマーAC-10SH[Ⓐ]、同10H[Ⓐ]、アロンA-10H[Ⓐ]等を好適に使用し得る。

なお、本発明組成物に有機溶剤を配合する場合、

く低下するため、組成物を手にとろうとしてもそれが手、指から流れ落ちて手にとりにくいという問題があり、これに対してあらかじめ組成物中に微量の塩化ナトリウムを添加しておくことが提案されている(特開昭55-40604)が、この方法は上記問題点の改良に充分有効でない上、製品の粘度が著しく低く抑えられるため、組成物が軟膏としては使用難くなるという欠点があるのに対し、上述したようにポリアクリル酸又はその塩を配合することにより、組成物の粘度が微量の塩分によつて著しく低下することが防止され、組成物が手にとり易くなるものである。ここで、ポリアクリル酸又はその塩としては架橋型でなく直鎖状のものが好ましく、またポリアクリル酸又はその塩の配合量は組成物全体の0.05～0.5%、特に0.05～0.3%とすることが好ましい。なお、ポリアクリル酸又はその塩としてはジユリマーAC-10SH[Ⓐ]、同10H[Ⓐ]、アロンA-10H[Ⓐ]等を好適に使用し得る。

本発明の外用ゲル組成物には、その種類又は使

用目的等に応じて、香料、それに殺菌剤、局麻剤、抗ヒスタミン剤、消炎鎮痛剤、収れん剤、サルファ剤、ビタミン類、抗真菌剤、末梢神経麻痺剤、血行促進剤、副腎皮質ホルモン、昆虫忌避剤、生薬エキス、テンキ、生薬粉末などの生理活性を有する薬物等の1種又は2種以上を組成物全体の0～30％程度配合し得る。

本発明外用ゲル組成物の製造法には特に制限はなく、通常の方法により製造し得る。

発明の効果

以上説明したように、本発明に係る外用ゲル組成物は、水が80％以下の外用ゲル組成物において、ゲル化剤としてカルボキシビニルポリマーを組成物全体の0.2～1.5％、1％水溶液の粘度が100 cps以上であるヒドロキシエチルセルロースを組成物全体の0.05～0.5％配合したことにより、「よれ」の発生が効果的に防止されるものである。

次に実施例及び比較例を示し、本発明を具体的に説明する。

〔実施例、比較例〕

カルボキシビニルポリマーをゲル化剤とした下記表に示す組成の実施例1～6及び比較例1～6の外用ゲル組成物を常法により調製した。

次に、各組成物の「よれ」及び「手へのとり易さ」を下記評価基準により官能評価した。結果を表に併記する。

「よれ」の評価基準

◎：塗布時、塗擦時に「よれ」が全く生じない。

○：「よれ」ほとんど生じない。

×：「よれ」生じる。

「手へのとり易さ」の評価基準

○：手にとり易い

△：液状化して手、指よりややすべり、ややとりにくい。

×：液状化して手、指よりすべつてしまい、とりにくい。

表

| 成 分 | 実 施 例 | | | | | | 比 較 例 | | | | | |
|-------------------------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| | 1 | 2 | 3 | 4 | 5 | 6 | 1 | 2 | 3 | 4 | 5 | 6 |
| サリチル酸メチル | 3.5 | 3.5 | 3.5 | 10 | 3.5 | 3.5 | | | | | 3.5 | 3.5 |
| サリチル酸グリコール | 1.8 | 1.8 | 1.8 | 5 | 1.8 | 1.8 | | | | | 1.8 | 1.8 |
| β-メントール | 4.0 | 4.0 | 4.0 | 7 | 4.0 | 4.0 | | | | | 4.0 | 4.0 |
| β-グリチルレチン酸 | | | | | 0.2 | 0.2 | | | | | | |
| カルボキシビニルポリマー(カーボール940®) | 1.0 | 1.0 | 1.0 | 1.0 | 1.0 | | 1.0 | 1.0 | 1.0 | 1.0 | 1.0 | 1.0 |
| 「ハイビスワコー104®」 | | | | | | 1.0 | | | | | | |
| トリエタノールアミン | 1.0 | 1.0 | 1.0 | 0.3 | | | 1.0 | 1.0 | 1.0 | 1.0 | 1.0 | 1.0 |
| ジブエンヒドラミン | | | | | 1.0 | 1.0 | | | | | | |
| エタノール | 31.9 | 31.1 | 31.1 | 26.0 | 30.1 | 30.1 | | 18.0 | 38.0 | 58.0 | 31.9 | 31.9 |
| プロピレングリコール | 21.2 | 20.8 | 20.7 | 26.0 | 30.1 | 30.1 | | | | | 21.3 | 21.2 |
| 精製水 | 35.4 | 34.6 | 34.5 | 22.3 | 25.8 | 25.8 | 98.0 | 80.0 | 60.0 | 40.0 | 35.5 | 35.4 |
| ヒドロキシエチルセルロース | | | | | | | | | | | | 0.2 |
| (HEC Qp300H® 液) | | | | | | | | | | | | |
| ヒドロキシエチルセルロース | 0.2 | 0.2 | 0.2 | 0.2 | 0.2 | 0.2 | | | | | | |
| (HEC Qp52000® 液) | | | | | | | | | | | | |
| ポリアクリル酸(ジュリマー10SH®) | | | 0.2 | 0.2 | 0.2 | 0.2 | | | | | | |
| ベンジルアルコール | | 2.0 | 2.0 | 2.0 | 2.0 | 2.0 | | | | | | |
| エデト酸ナトリウム | | | | | 0.002 | 0.002 | | | | | | |
| 合 計 | 100.0 | 100.0 | 100.0 | 100.0 | 100.0 | 100.0 | 100.0 | 100.0 | 100.0 | 100.0 | 100.0 | 100.0 |
| よ れ | ○ | ◎ | ◎ | ◎ | ◎ | ◎ | ◎ | × | × | × | × | × |
| 手への取り易さ | × | × | ○ | ○ | ○ | ○ | ◎ | △ | × | × | × | × |

液 1％水溶液の粘度 35 cps

液 2500 cps

表の結果より、ゲル組成物に有機溶媒を配合することにより「よれ」が発生し、かつ組成物が手にとりにくくなることが認められると共に、組成物に1号水溶液の粘度が高いヒドロキシエチルセルロースを配合することにより有機溶媒を含む場合でも「よれ」の発生が良好に抑制されることが知見された。また、この場合ベンジルアルコールを配合することによつて「よれ」の発生がより確実になされるものであつた。また、ポリアクリル酸を配合することにより、組成物の表面粘度が微量の塩分によつて低下しすぎて手にとりにくくなるのを防止できることが認められた。

出願人 ライオン株式会社

代理人 弁理士 小 島 隆 司